

(12) 按照专利合作条约所公布的国际申请

(19) 世界知识产权组织
国际局



(43) 国际公布日:
2005年5月19日(19.05.2005)

PCT

(10) 国际公布号:
WO 2005/044805 A1

(51) 国际分类号⁷: C07D 231/26, 213/50, A61K 31/445

(21) 国际申请号: PCT/CN2004/001227

(22) 国际申请日: 2004年10月28日(28.10.2004)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(30) 优先权:
200310106920.3 2003年11月5日(05.11.2003) CN

(71) 申请人(对除美国以外的所有指定国): 天津和美生物技术有限公司(TIANJIN HEMEY BIO-TECH CO., LTD.) [CN/CN]; 中国天津市经济技术开发区晓园新村31-101, Tianjin 300457 (CN)。

(72) 发明人;及

(75) 发明人/申请人(仅对美国): 张和胜(ZHANG, Hesheng) [CN/CN]; 中国天津市经济技术开发区晓园新村31-101, Tianjin 300457 (CN)。

(74) 代理人: 天津才智专利商标代理有限公司(TIANJIN CAIZHI PATENT & TRADEMARK AGENCY, LTD) 中国天津市和平区卫津路149号云琅新居A座2门1302号, Tianjin 300070 (CN)。

(81) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的国家保护):
AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW

(84) 指定国(除另有指明, 要求每一种可提供的地区保护):
ARIPO(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚专利(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧洲专利(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

根据细则4.17的声明:

— 发明人资格(细则4.17(iv))仅对美国

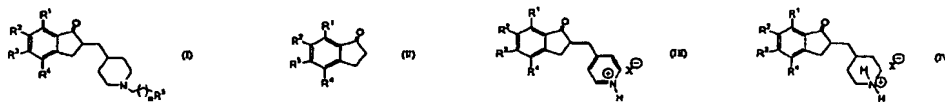
本国际公布:

— 包括国际检索报告。

所引用双字母代码和其它缩写符号, 请参考刊登在每期PCT公报期刊起始的“代码及缩写符号简要说明”。

(54) Title: A NOVEL PROCESS FOR PREPARING DONEPEZIL AND ITS DERIVATIVES

(54) 发明名称: 合成多奈哌齐及其衍生物的新方法



(57) Abstract: The invention provides a novel process for preparing Donepezil and its derivatives of formula (I), wherein R₁, R₂, R₃, and R₄ represent each H, F, C₁-4 alkyl or C₁-4 alkoxy, R₅ represents phenyl or substituted phenyl, and n is 0, 1 or 2, which is characterized by that it comprises the steps of: reacting 4-pyridylaldehyde with a compound of formula (II) to form a compound of formula (III), catalytically hydrogenating the compound of formula (III) to form a compound of formula (IV), and alkylating the compound of formula (IV) to give the compound of formula (I).

[见续页]



(57) 摘要

一种合成多奈哌齐及其衍生物的新方法。本发明涉及制备式 (I) 所示的多奈哌齐及其衍生物的新方法，其中 R¹、R²、R³ 和 R⁴ 分别表示为 H、F、C1-4 烷基或 C1-4 烷氧基，R⁵ 表示苯基或取代的苯基，n 为 0、1 或 2，其特征为所述的方法包括下列反应步骤：4-吡啶甲醛与式 (II) 所示的化合物反应生成式 (III) 所示化合物，式 (III) 所示化合物经催化氢化得到式 (IV) 所示化合物，式 (IV) 所示化合物经烷基化过程得到式 (I) 所示的化合物。

